(19) 世界知的所有権機関 国際事務局



. | 1887 | 1888 | 1888 | 1888 | 1888 | 1888 | 1888 | 1888 | 1888 | 1888 | 1888 | 1889 | 1889 | 1889 | 1889 | 1

(43) 国際公開日 2005 年2 月10 日 (10.02.2005)

PCT

(10) 国際公開番号 WO 2005/012248 A1

(51) 国際特許分類⁷: **C07D 211/58**, 211/64, 221/20, 495/04, 471/10, A61K 31/451, 31/438, A61P 1/00, 1/08, 25/04, 25/06, 25/22, 11/00, 43/00

(21) 国際出願番号:

PCT/JP2004/011065

(22) 国際出願日:

2004年8月2日(02.08.2004)

(25) 国際出願の言語:

日本語

(26) 国際公開の言語:

日本語

(30) 優先権データ:

特願2003-205114 2003年7月31日(31.07.2003) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): ゼリア新薬工業株式会社 (ZERIA PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1038351 東京都中央区日本橋小舟町10番11号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 長澤 正明 (NAGA-SAWA, Masaaki) [JP/JP]; 〒3600111 埼玉県大里郡江南町押切2512-1ゼリア新薬工業株式会社中央研究所内 Saitama (JP). 川瀬 伸雄 (KAWASE, Nobuo) [JP/JP]; 〒3600111 埼玉県大里郡江南町押切2512-1ゼリア新薬工業株式会社中央研究所内 Saitama (JP). 田中伸幸 (TANAKA, Nobuyuki) [JP/JP]; 〒3600111 埼玉県大里郡江南町押切2512-1ゼリア新薬工業株式会社中央研究所内 Saitama (JP). 中村 英樹 (NAKAMURA, Hideki) [JP/JP]; 〒3600111 埼玉県大里郡江南町押切2512-1ゼリア新薬工業株式会社中央研究所内 Saitama (JP). 続池 直樹 (TSUZUIKE, Naoki) [JP/JP]; 〒3600111 埼玉県大里郡江南町押切2512-1ゼリア

新薬工業株式会社中央研究所内 Saitama (JP). 村田 正和 (MURATA, Masakazu) [JP/JP]; 〒3600111 埼玉県大里郡江南町押切2512–1ゼリア新薬工業株式会社中央研究所内 Saitama (JP).

- (74) 代理人: 特許業務法人アルガ特許事務所 (THE PATENT CORPORATE BODY ARUGA PATENT OFFICE); 〒1030013 東京都中央区日本橋人形町 1 丁目3番6号共同ビル Tokyo (JP).
- (81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

- 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: BENZYLAMINE DERIVATIVE

(54) 発明の名称: ペンジルアミン誘導体

$$\begin{array}{c|c}
X^{2} & R^{2} \\
R^{5} & N & O \\
N & O \\
N & N \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
R^{4} \\
R^{3} \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N \\
N & O \\
N \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N \\
N & O \\
N \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
1 \\
N & O \\
N & N$$

(57) Abstract: A compound which has satisfactory oral absorbability and excellent antagonistic activity against an NK-1 receptor or NK-2 receptor. It is a benzylamine derivative represented by the general formula (1): [Chemical formula 1] (1) or a salt thereof.

(57) 要約:

良好な経口吸収性を示し、NK-1受容体又はNK-2受容体に対して優れた拮抗作用を有する化合物を提供すること。

一般式(1):

【化1】

$$\begin{array}{c|c}
X^{2} & R^{2} \\
R^{5} & N^{2} & R^{3} \\
R^{1} & N^{1} & N^{3} \\
X^{4} & X^{4}
\end{array}$$
(1)

で表わされるベンジルアミン誘導体又はその塩。